上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话：021-61312973　　传真：021-55068248
网址：www.shyuanye.com
邮箱：shyysw@sina.com

产品名称：TRi-1
CAS 号：246020-68-8
产品货号：S87818

生物活性：

Description	TRi-1 是有效的、特异性的、不可逆的胞质硫氧还蛋白还原酶 1 (TXNRD1) 的抑制剂，其 IC50 值为 12 nM。TRi-1 有抗肿瘤活性，且线粒体毒性很小。
IC50 & Target	IC50: 12 nM (TXNRD1)[1]
In Vitro	TRi-1 (0.679 和 6.79 μM；6 小时) 对 FaDu 细胞中的细胞谷胱甘肽 (GSH) 浓度没有影响，有效激活 JNK 和 p38 磷酸化[1]。 TRi-1 (2 μM) 以 NADPH 依赖性方式不可逆地抑制 TXNRD1[1]。 TRi-1 (0.1-10 μM；0-10 h) 以浓度和时间依赖性方式在培养的 FaDu 细胞中增加 H2O2 产生[1]。 TRi-1 (10 nM-100 μM；48 h) 显示出对癌细胞的细胞毒性[1]

Western Blot Analysis[1]

Cell Line:	FaDu cells
Concentration:	0.679 and 6.79 μM
Incubation Time:	6 h
Result:	Efficiently activated JNK and p38 phosphorylation.

Cell Cytotoxicity Assay[1]

Cell Line:	Leukemia, non-small cell lung, CNS, colon, melanoma, ovarian, renal, prostate and breast cancer cells
Concentration:	10 nM-100 μM
Incubation Time:	48 h
Result:	Displayed potency against every cell line tested, with an average growth inhibition to 50% (GI50) of 6.31 μM.

In Vivo

TRi-1 (10 mg/kg，静脉注射；每天两次，持续 4 天或 5 mg/kg；腹腔注射；每周两次，持续 3 周) 损害人肿瘤异种移植物和同源小鼠肿瘤的生长和活力[1]。

Animal Model:	SCID mice bearing established human FaDu cell xenografts[1]
Dosage:	10 mg/kg
Administration:	Intravenous injection, twice a day for 4 days
Result:	Resulted in decreased tumor growth compared to vehicle controls within four days with no signs of overt toxicity or changes in mouse weight relative to vehicle control.
Animal Model:	PyMT-MMTV mice that spontaneously develop malignant breast cancer tumors[1]
Dosage:	5 mg/kg
Administration:	Intraperitoneal injection, twice a week for 3 weeks
Result:	Impaired tumor growth, significantly reduced tumor volumes.

Solvent&Solubility

细胞实验:

DMSO 中的溶解度 ：62.5 mg/mL (190.13 mM; 超声助溶；吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影响，请使用新开封的 DMSO)

	Solvent / Mass / Concentration	1 mg	5 mg	10 mg

上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话：021-61312973　　传真：021-55068248
网址：www.shyuanye.com
邮箱：shyysw@sina.com

	Preparing Stock Solutions	1 mM	3.0420 mL	15.2100 mL	30.4201 mL
		5 mM	0.6084 mL	3.0420 mL	6.0840 mL
		10 mM	0.3042 mL	1.5210 mL	3.0420 mL

*请根据产品在不同溶剂中的溶解度选择合适的溶剂配制储备液；一旦配成溶液，请分装保存，避免反复冻融造成的产品失效。

储备液的保存方式和期限：-80°C, 6 months; -20°C, 1 month (protect from light)。-80°C 储存时，请在 6 个月内使用，-20°C 储存时，请在 1 个月内使用。

动物实验：

请根据您的实验动物和给药方式 选择适当的溶解方案。

以下溶解方案都请先按照 In Vitro 方式配制澄清的储备液，再依次添加助溶剂：

——为保证实验结果的可靠性，澄清的储备液可以根据储存条件，适当保存；体内实验的工作液，建议您现用现配，当天使用；

以下溶剂前显示的百分比是指该溶剂在您配制终溶液中的体积占比；如在配制过程中出现沉淀、析出现象，可以通过加热和/或超声的方式助溶

方案 一

请依序添加每种溶剂： 10% DMSO → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 45% Saline

Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (6.33 mM); 澄清溶液

此方案可获得 ≥ 2.08 mg/mL（饱和度未知）的澄清溶液。

以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 20.8 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 μL PEG300 中，混合均匀；再向上述体系中加入 50 μL Tween-80，混合均匀；然后再继续加入 450 μL 生理盐水 定容至 1 mL。

生理盐水的配制：将 0.9 g 氯化钠，溶解于 ddH_2O 并定容至 100 mL，可以得到澄清透明的生理盐水溶液。

方案 二

请依序添加每种溶剂： 10% DMSO → 90% Corn Oil

Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (6.33 mM); 澄清溶液

此方案可获得 ≥ 2.08 mg/mL（饱和度未知）的澄清溶液，此方案实验周期在半个月以上的动物实验酌情使用。

以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 20.8 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 玉米油中，混合均匀。

参考文献

[1]. Stafford WC, et al. Irreversible inhibition of cytosolic thioredoxin reductase 1 as a mechanistic basis for anticancer therapy. Sci Transl Med. 2018 Feb 14;10(428). pii: eaaf7444.

完整储备液配制表：

请根据产品在不同溶剂中的溶解度选择合适的溶剂配制储备液；一旦配成溶液，请分装保存，避免反复冻融造成的产品失效。

储备液的保存方式和期限：-80° C, 6 months; -20° C, 1 month (protect from light)。-80° C 储存时，请在 6 个月内使用，-20° C 储存时，请在 1 个月内使用。

可选溶剂	**质量 / 溶剂体积 / 浓度**	**1 mg**	**5 mg**	**10 mg**	**25 mg**
DMSO	**1 mM**	3.0420 mL	15.2101 mL	30.4201 mL	76.0503 mL
	5 mM	0.6084 mL	3.0420 mL	6.0840 mL	15.2101 mL

上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话：021-61312973　　传真：021-55068248
网址：www.shyuanye.com
邮箱：shyysw@sina.com

	10 mM	0.3042 mL	1.5210 mL	3.0420 mL	7.6050 mL
	15 mM	0.2028 mL	1.0140 mL	2.0280 mL	5.0700 mL
	20 mM	0.1521 mL	0.7605 mL	1.5210 mL	3.8025 mL
	25 mM	0.1217 mL	0.6084 mL	1.2168 mL	3.0420 mL
	30 mM	0.1014 mL	0.5070 mL	1.0140 mL	2.5350 mL
	40 mM	0.0761 mL	0.3803 mL	0.7605 mL	1.9013 mL
	50 mM	0.0608 mL	0.3042 mL	0.6084 mL	1.5210 mL
	60 mM	0.0507 mL	0.2535 mL	0.5070 mL	1.2675 mL
	80 mM	0.0380 mL	0.1901 mL	0.3803 mL	0.9506 mL
	100 mM	0.0304 mL	0.1521 mL	0.3042 mL	0.7605 mL